

BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND

08.11.2005



**Prioritätsbescheinigung über die Einreichung
einer Patentanmeldung**

Aktenzeichen: 10 2004 040 178.0
Anmeldetag: 18. August 2004
Anmelder/Inhaber: AQUANOVA German Solubilisate Technologies
(AGT) GmbH, 64295 Darmstadt/DE
Bezeichnung: Liponsäure-Konzentrat
IPC: A 23 L 1/30

Die angehefteten Stücke sind eine richtige und genaue Wiedergabe der ursprünglichen Unterlagen dieser Patentanmeldung.

München, den 24. Oktober 2005
Deutsches Patent- und Markenamt
Der Präsident
 Im Auftrag

Die Erfindung betrifft ein α -Liponsäure-Konzentrat gemäß DE 101 08 614 A1.

Die an Ratten durchgeführte Untersuchung von Min-Seon Kim et. al. (NATURE MEDCINE Band 10, Nr. 7, Juli 2004, Seiten 727-734) zeigt, dass der α -Liponsäure eine gewisse appetitunterdrückende Wirkung zugeschrieben werden kann. Für den Menschen zeichnet sich daher die Möglichkeit ab, dass ein durch Aufnahme von Liponsäure vermindertes Bedürfnis zur Nahrungsaufnahme zu einer Gewichtsreduzierung führt.

10 Dementsprechend ist es Aufgabe der Erfindung, eine nebenwirkungslose Zusammensetzung der eingangs genannten Art anzugeben, die zur Gewichtsreduzierung beitragen oder diese verbessern kann.

15 Aus dem Dokument WO 03/007907 ist ein Ubichinon-Konzentrat bekannt, welches aus einem Emulgator, dem Ubichinon Q₁₀ sowie einem leichten pflanzlichen Öl (Distelöl) besteht. Dieses Konzentrat hat die Eigenschaft, das Q₁₀, das in den Mitochondrien zum Fettabbau benötigt wird, dem Organismus leichter verfügbar zu machen.

20 Die deutsche Offenlegungsschrift DE 101 08 614 A1, Ausführungsbeispiel d, lehrt die Herstellung eines aus α -Liponsäure und Polysorbat bestehenden, wasserlöslichen α -Liponsäure-Solubilisats.

25 Die Erfindung basiert daher auf der Konzeption, einerseits den Fettabbau durch Bereitstellung einer ausreichenden Menge Q₁₀ zu fördern und andererseits den Fettabbau auf im Organismus gespeichertes Fett zu beschränken, indem die gleichzeitige Gabe von α -Liponsäure eine Nahrungsneuaufnahme durch Beeinflussung des Hypothalamus bremst. Daher ist Gegenstand der Erfindung ein wasserfreies Konzentrat, welches aus dem Ubichinon Q₁₀, einem mittelkettigen
30 Triglycerid oder einem Triglyceridgemisch, α -Liponsäure und einem Polysorbat besteht. Diese Bestandteile sind lebensmittelrechtlich zugelassen und nebenwirkungsfrei. Das Konzentrat ist bei geeigneten Gewichtsanteilen seiner Bestandteile bei Raumtemperatur klar und viskos und lässt sich vorzugsweise bei

leicht erhöhter Temperatur von etwa 60 °C ohne Schwierigkeiten zu einem Inhalt von Kapseln verarbeiten. Die tägliche Verabreichung einer derartigen Kapsel kann eine Gewichtsabnahme des Organismus bewirken.

5 Bevorzugte Ausführungsformen der Erfindung sind in den Unteransprüchen angegeben. So erweist es sich als zweckmäßig, die α-Liponsäure statt mit Polysorbat 80 mit Polysorbat 20 zu solubilisieren. Weiter empfiehlt es sich, den Gewichtsanteil des Polysorbats 80 zu etwa dem Dreifachen des Gewichtsanteils der weiteren Bestandteile zu bestimmen. Der Polysorbatanteil kann auch etwa das
10 4,8fache des Gewichtsanteils der weiteren Bestandteile betragen. Besonders günstig ist ein Konzentrat, welches aus etwa 82 Gew% Polysorbaten, etwa 3,3 Gew% Q₁₀, etwa 4 Gew% α-Liponsäure und etwa 10 Gew% Triglyceriden besteht. Zur Herstellung des erfindungsgemäßen Konzentrats geht man zweckmäßig so vor, dass zunächst ein Solubilisat aus Q₁₀, Polysorbat 80 und einem mittelkettigen
15 Triglycerid, sodann ein Solubilisat aus α-Liponsäure und Polysorbat 80 oder Polysorbat 20 gewonnen wird und anschließend das Q₁₀-Solubilisat mit dem α-Liponsäure-Solubilisat gemischt und zu einer homogenen, klaren und in Wasser
löslichen Masse verrührt wird. Es empfiehlt sich, das Q₁₀-Solubilisat mit dem α-Liponsäure-Solubilisat im Gewichtsverhältnis von etwa 2:1 zu mischen, wobei mit
20 Vorteil bei einer erhöhten Misch- und Verrührtemperatur von beispielsweise 60 °C gearbeitet wird.

Ein Ausführungsbeispiel der Erfindung wird nachstehend im Einzelnen erläutert.

25 Ausgegangen wird von einem 5%igen wasserfreien, wasserlöslichen Q₁₀-Solubilisat, wie es in dem Herstellungsbeispiel 2 in dem Dokument WO 03/007907 beschrieben ist. Danach werden 790 Gewichtsteile Polysorbat 80 auf ca. 85 °C erhitzt. Dann werden 50 Gewichtsteile Coenzym Q₁₀ hinzugegeben und die Mischung (840 Gewichtsteile) unter Beibehaltung der Temperatur von ca. 85 °C so lange (etwa 5 Minuten) gerührt, bis sie homogen und transparent geworden ist.
30 Anschließend werden dieser Mischung 160 Gewichtsteile Distelöl zugegeben, nachdem dieses zuvor ebenfalls auf ca. 85 °C erwärmt worden war, und unter Beibehaltung der Temperatur von ca. 85 °C so lange (etwa 2 Minuten) gerührt, bis die gesamte Mischung (1000 Gewichtsteile) ebenfalls homogen und transparent

geworden ist. Nach Abkühlung auf Raum- oder Körpertemperatur bleiben Klarheit und Wasserlöslichkeit erhalten. Ein Gramm dieses Solubilisats enthält 50 mg Q₁₀.

Dort ist zwar als Bestandteil Distelöl angegeben. Erfindungsgemäß kann das 5 Distelöl durch eine mittelkettige Triglyceridmischung gleicher Menge ersetzt werden, das gesättigte Pflanzenfettsäuren mittlerer Kettenlänge enthält, im Wesentlichen aus Caprylsäure und Caprinsäure besteht und beispielsweise von der Firma Sasol GmbH unter dem Namen Miglyol 812 N angeboten wird.

10 Sodann wird ein 10%iges wasserfreies, wasserlösliches α-Liponsäure-Solubilisat hergestellt, indem 900 Gewichtsteile Polysorbat 20 zunächst auf etwa 60 °C erwärmt werden. In das warme Polysorbat 20 werden langsam 100 Gewichtsteile α-Liponsäure (CAS-Nr. 62-46-4; ALIPURE der Firma Degussa) eingerieselten. Unter fortgesetztem Rühren wird das Gemisch so lange thermisch behandelt, bis dieses 15 bei ca. 120 °C zu einer transparenten Mischung wird. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur bleibt die Mischung transparent und ist in dieser Form vollständig wasserlöslich. 1 g dieses Solubilisats enthält 100 mg α-Liponsäure. Die Benutzung von Polysorbat 20 erleichtert zwar die Solubilisierung; jedoch ist an seiner Stelle eine gleiche Menge von Polysorbat 80 aus sensorischen Gründen 20 vorzuziehen.

Zur Gewinnung eines Q₁₀-α-Liponsäure-Solubilisates werden etwa 660 25 Gewichtsteile des Q₁₀-Solubilisates mit etwa 370 Gewichtsteilen des α-Liponsäure-Solubilisates bei einer Temperatur von etwa 60 °C zu einer homogenen Mischung verrührt. Diese Mischung enthält 33 Gewichtsteile Q₁₀ und 37 Gewichtsteile α-Liponsäure, die beide in Polysorbat-Micellen von etwa 10 nm 30 Teilchendurchmesser eingeschlossen sind. Mit dieser Mischung wird eine Kapsel aus Gelatine oder gelatinefrei mit 470 mg Füllgewicht befüllt. Der Inhalt dieser Kapsel besteht dann aus etwa 15,02 mg Q₁₀, etwa 16,68 mg α-Liponsäure, etwa 48,22 mg Triglyceriden und etwa 389,7 mg Polysorbat 80.

Bei einer Aufnahme von beispielsweise drei derartiger Kapseln pro Tag werden daher vom Organismus aufgenommen etwa

- 45,15 mg Q₁₀
- 50,58 mg α-Liponsäure
- 144,66 mg Triglyceride
- 1169,1 mg Polysorbat 80.

5

Diese Mengen bleiben weit unterhalb derjenigen maximalen Tagesdosis, die amtlicherseits für die jeweiligen Bestandteile lebensmittelrechtlich zugelassen ist.

10

Das erfindungsgemäße Q₁₀-α-Liponsäure-Konzentrat kann aufgrund seiner Wasserlöslichkeit, insbesondere in leicht erwärmtem (etwa 35 °C) Wasser, alkoholfreien Getränken in geeigneter Dosis beigemischt werden, ohne dass die Klarheit des Getränks Einbußen erleidet. Ferner kann das erfindungsgemäße Konzentrat Salben oder anderen kosmetischen Mitteln beigegeben werden, weil die Micellenstruktur des Konzentrats eine Penetration in die Haut erleichtert.

15

Schließlich bietet sich das erfindungsgemäße Konzentrat als Nahrungsergänzungsmittel oder, in höherer Dosierung, auch als dietätisches Lebensmittel an.

1. Wasserfreies Konzentrat, bestehend aus Polysorbat 80, Q₁₀, α-Liponsäure und einem mittelkettigen Triglycerid.
2. Konzentrat nach Anspruch 1 mit einem Gehalt an Polysorbat 20.
3. Konzentrat nach Anspruch 2, in welchem der Gewichtsanteil des Polysorbates 80 etwa das Dreifache des Gewichtsanteils der weiteren Bestandteile beträgt.
4. Konzentrat nach Anspruch 1, in welchem der Gewichtsanteil des Polysorbats etwa das 4,8fache des Gewichtsanteils der weiteren Bestandteile beträgt.
5. Konzentrat nach einem der vorstehenden Ansprüche, welches aus etwa 82 Gew% Polysorbaten, etwa 3,3 Gew% Q₁₀, etwa 4 Gew% α-Liponsäure und etwa 10 Gew% Triglyceriden besteht.
6. Verfahren zur Herstellung eines Konzentrats nach einem der vorstehenden Ansprüche, bei welchem zunächst ein Solubilisat aus Q₁₀, Polysorbat 80 und einem Triglycerid, sodann ein Solubilisat aus α-Liponsäure und Polysorbat 80 oder Polysorbat 20 gewonnen wird und anschließend das Q₁₀-Solubilisat mit dem α-Liponsäure-Solubilisat gemischt und zu einer homogenen Masse verrührt wird.
7. Verfahren nach Anspruch 6, bei welchem mit einer erhöhten Misch- und Verrührtemperatur von beispielsweise 60 °C gearbeitet wird.
8. Verfahren nach Anspruch 6 oder 7, bei welchem das Q₁₀-Solubilisat mit dem α-Liponsäure-Solubilisat im Gewichtsverhältnis von etwa 2:1 vermischt wird.

Document made available under the Patent Cooperation Treaty (PCT)

International application number: PCT/EP05/008940

International filing date: 18 August 2005 (18.08.2005)

Document type: Certified copy of priority document

Document details: Country/Office: DE
Number: 10 2004 040 178.0
Filing date: 18 August 2004 (18.08.2004)

Date of receipt at the International Bureau: 14 December 2005 (14.12.2005)

Remark: Priority document submitted or transmitted to the International Bureau in compliance with Rule 17.1(a) or (b)



World Intellectual Property Organization (WIPO) - Geneva, Switzerland
Organisation Mondiale de la Propriété Intellectuelle (OMPI) - Genève, Suisse

BEST AVAILABLE COPY